

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 62-148416

(43)Date of publication of application : 02.07.1987

(51)Int.Cl. A61K 7/06

(21)Application number : 60-291054 (71)Applicant : KANEBO LTD

(22)Date of filing : 23.12.1985 (72)Inventor : MOTOI TOSHIYUKI

(54) HAIR TONIC

(57)Abstract:

PURPOSE: A hair tonic, containing 2,4-diamino-6-piperidino-pyrimidine-3-oxide ad oxendolone, capable of exhibiting remarkably good hair growth promoting effect, stable even in preservation for a long period and having improved effect on inhibition of dandruff and itching.

CONSTITUTION: A hair tonic containing (A) 2,4-diamino-6-piperidino-pyrimidine-3- oxide and (B) oxendolone (16β -ethyl- 17β -hydroxy-4-estren-3-one) at 25:0.1W1:1 weight ratio of the ingredients (A) to (B). The amounts of the ingredients (A) and (B) based on the total weight of the hair tonic are as follows; 0.05W5wt% ingredient (A) and 0.005W0.5wt% ingredient (B). The above-mentioned hair tonic is capable of exhibiting effect, e.g. remarkable promotion of hair growth, conversion of live hair into rigid hair, prevention of depilation, suppression of sebum secretion, inhibition of dandruff formation, etc. The hair tonic is formulated into a dosage form, e.g. hair tonic, hair lotion, hair cream, etc., according to a conventional method.

⑨ 日本国特許庁 (JP)

⑩ 特許出願公開

⑪ 公開特許公報 (A) 昭62-148416

⑫ Int.Cl. 4

A 61 K 7/06

識別記号

庁内整理番号

7417-4C

⑬ 公開 昭和62年(1987)7月2日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑭ 発明の名称 髪毛料

⑮ 特願 昭60-291054

⑯ 出願 昭60(1985)12月23日

⑰ 発明者 元井 利幸 小田原市高田大字北ノ前139番地の6

⑱ 出願人 錦紡株式会社 東京都墨田区墨田5丁目17番4号

明細書

1. 発明の名称

髪毛料

2. 特許請求の範囲

2,4-ジアミノ-6-ビペリジノ-ビリミジン-3-オキサイドとオキセンドロンとを含有することを特徴とする髪毛料。

3. 発明の詳細な説明

(施設上の利用分野)

本発明は、2,4-ジアミノ-6-ビペリジノ-ビリミジン-3-オキサイドとオキセンドロンとを含有することを特徴とする髪毛料に関する。

(従来の技術)

脱毛症には多くの薬剤がその治療に応用されている。即ち、頭皮の血行を促進したり、毛母細胞を活性化したり、毛髪の栄養成分であるアミノ酸やビタミン剤を配合する例が多い。また、最近では、男性ホルモン過剰に起因する性ホルモンのアンバランスが脱毛症の原因であるとの説がたどられ、その原因に古く抗男性ホルモン剤を配合

する髪毛料が考案されている。

しかしながら、これらの髪毛料によっては、充分な効果は得られていないのが現状である。

(発明が解決しようとする課題)

本発明者は脱毛症の原因は性ホルモンのアンバランスのみに起因するのではなくて、血行の不全や毛母細胞活性の低下等も同時に原因として寄与していると考え、頭皮の数多くの薬剤及びそれらの組合せについて観察研究した結果、2,4-ジアミノ-6-ビペリジノ-ビリミジン-3-オキサイドとオキセンドロンとを含有した髪毛料が、

- (1) 善しく毛成長を促進すること、
- (2) 生毛が剛毛化すること、
- (3) 脱毛を予防すること、
- (4) 血液の分泌を抑制すること、
- (5) 上げの生成を抑制すると等を見出し、本発明を完成した。

(問題点を解決するための手段)

即ち、本発明は、2,4-ジアミノ-6-ビペリ

ジノーピリミジン-8-オキサイトとオキセンドロンとを含有することを特徴とする造毛料である。

9,4-ジアミノ-6-ビペリジノーピリミジン-8-オキサイドは公知の物質で(usp 3,461,481 usp 4,186,819)，別名6-アミノ-1,2-ジヒドロ-1-ヒドロキシ-2-イミノ-4-ビペリジノピリミジンである。以下、化合物Aと総記する。

オキセンドロンは化学名が $1\beta,2\beta$ -エチル- $1\beta,2\beta$ -ヒドロキシ-4-ニストレン-3-オノンで公知の物質である(特開昭53-162512)。

本発明の造毛料に配合される化合物Aの配合量は、組成物の全量に対して通常0.05～5重量%である。

一方、オキセンドロンの配合量は通常0.005～0.5重量%である。そして、化合物Aとオキセンドロンとは2.5:0.1～1:1の構成割合で含有されていることが好ましい。

本発明の造毛料は、常法に従って、ヘアートニック、ヘアーローション、ヘアークリーム等の形

明確ではないが、両化合物の効果が相補的・相乘的に増大したものと考えられる。

(実施例)

以下、実施例、比較例の記載に基づいて本発明を詳説する。また、白色マウスに対する毛成長促進効果、ヒト頭髪に対する毛成長促進効果等の試験方法を下記に示す。

(1) マウス毛成長促進効果試験方法

64♀系白色マウス(雄、6週齢、平均体重85g)の尾部よりの背筋皮膚を電気バリカンで刈った後、脱毛クリームにより完全に除毛し、翌日より実施例及び比較例の各試料を該部位皮膚に毎日朝夕2回、一回当たり0.1mgを塗布した。一試料に対して動物は一匹10匹使用した。毛成長効果の判定は、第1表に示す判定基準による肉眼判定の評価点と毛長、毛量を比較例と比較することにより行った。

実験開始後16日目に動物を屠殺し第1表に示す判定基準により肉眼判定し、その評価点を合計し、一匹当たりの平均評価点を求めた。さらに、

型に調整することが可能である。本発明の造毛料における基剤としては、例えば水、エタノール等のアルコール類、グリセリン等の多価アルコール類、流動パラフィン、高級脂肪酸(ステアリン酸等)、脂肪酸グリセライド(グリセリンモノステアレート等)、高級アルコール、動植物油、ワックス類等の油性物質、界面活性剤(乳化剤、可溶化剤)、軟膏剤、角質溶解剤等を適宜配合し得る。

(発明の効果)

本発明の造毛料は、ヒトまたは動物の皮膚に塗布すると頭髪良好な毛成長促進効果(毛成長率)を発揮し、かつ長期保存しても安定であって、その商品価値は極めて高い。また、ふけ、かゆみを抑制する効果にも優れた効果を発揮する。

更に後記実施例で示すように、本発明の造毛料は通常に低濃度配合にても効果を発揮するという特徴を有する。この事は、薬剤の少量使用による副作用発現の懸念よりみて非常に有用である。

公知の育毛剤の中から、本発明の組み合せが特に頭髪効果を発揮するメカニズムについては、

該部位の皮膚を切除し、直径1.2mmのパンチで、一定面積の皮膚を行き抜いて、乾燥後毛の量を測定し、その中の20本の毛の長さについても測定し、平均値を算出した。

第1表 造毛効果の評価点の判定基準

評価点	判定基準
6	周囲の非脱毛部との境界が不明
4	毛成長強度
3	毛成長中等度
2	毛成長弱度
1	毛成長極く弱度
0	毛成長認められず

(2) ヒト頭髪毛成長促進効果試験方法

所定人數の被験者(被験者の頭部の耳の上5cmの位置の頭髪を左右2ヶ所を直径1cm剃毛した被験部位に試料を左側に、对照例を右側と定めて毎日朝夕2回、約3mm塗布した。効果の判定は試験開始後28日目に、左右の被験部位の毛髪各々20本ずつ剃毛し、左側の毛20本の長さの平均値(即)を

右側の毛 20 本の長さの平均値(μ)で除した値を求めて評価した。(判定結果 試験者 10 名の(4)/(A)の平均値)

以下に、実施例及び比較例の実験方法及び実験結果について示す。尚、以下に示す % とは重量 % を意味する。

実施例 1 ~ 8、比較例 1 ~ 4

(1) 試方(ローション)

成 分	実施例 1		比較例 1		比較例 2		実施例 2		実施例 3		比較例 3		比較例 4	
	実施例 1	比較例 1	比較例 2	実施例 2	実施例 3	比較例 3	比較例 4	実施例 4	比較例 4	比較例 5	比較例 6	比較例 7	比較例 8	
化合物 A (g)	1.0	1.0	—	5	0.5	—	1.0							
オキセンドロン (g)	0.05	—	0.05	0.5	0.005	0.05	—							
9.5% エタノール (g)	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0					
イオン交換水 (g)	残量													
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油 (g)	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0					
硬化カルブロニウム (g)	—	—	—	—	—	—	—	—	—	1.0	—			
ビタミン A ₁ (g)	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.05				

実施例 4、比較例 5 ~ 7

(1) 試方

成 分	実施例 4	比較例			对照例
		5	6	7	
化合物 A (g)	0.05	0.05	—	—	—
オキセンドロン (g)	0.005	—	0.005	0.005	—
9.5% エタノール (g)	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0
イオン交換水 (g)	残量	残量	残量	残量	残量
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油 (g)	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
香料 (g)	適量	適量	適量	適量	適量
硬化カルブロニウム (g)	—	—	—	0.05	—

(2) 実験

本品の毛毛効果を健康な男子 10 名により、前記試験方法記載の「ヒト頭髪毛成長促進効果試験方法」により行なった。結果を第 8 表に示す。

(以下余白)

(2) 実験

上記試験を用いてマウス毛成長促進効果を実験した。その結果を第 2 表に示す。

第 2 表 マウス毛成長促進効果

番号	試 料	毛 長 (mm)	毛 量 (mg)	評価点
1	実施例 1	7.18	7.25	4.2
2	比較例 1	5.68	5.45	3.1
3	比較例 2	5.41	5.81	8.1
4	実施例 2	7.32	7.46	4.8
5	実施例 3	6.85	7.00	4.0
6	比較例 3	6.65	5.60	8.2
7	比較例 4	5.74	5.71	8.2

第 2 表から明らかなように、実施例 1 の毛長、毛量はともに比較例より大きく、また肉眼判定による評価点も高い値を示し、本発明の毛成長促進効果が著しい事が認められる。

また、実施例 2、実施例 3 においても、本発明の毛成長促進効果が著しい事がわかる。

第 3 表

試 料	毛 長 (mm)	平均値
実施例 5	1.80	
比較例 6	1.05	
同上 6	1.06	
同上 7	1.08	

第 3 表から明らかな如く、本発明品の毛成長促進効果は著しいことが判明した。また更に、頭髪において皮脂の分泌とふけの発生を減少する事が認められた。

(以下余白)

実施例5、比較例8～10

(1) 試方

成 分	実施例 5	比 較 例			対照例
		8	9	10	
化 合 物 A 油	0.5	0.5	—	—	—
オキセンドロン 油	0.05	—	0.05	0.05	—
9,5-ジニタノール 油	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0
イオン交換水 油	塗 塗	残 残	塗 塗	残 残	塗 塗
ポリオキシエチレン 硬化ヒマシ油 油	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
香 料 油	適 量	適 量	適 量	適 量	適 量
塗化カルボニクム 油	—	—	—	0.5	—

(2) 試験

本品の塗毛効果を男性型脱毛症患者5名により、
前記試験方法で行なった。結果を第4表に示す。

(以下省略)

第4表

試 料	回 [A] 平均値
実施例6	1.85
比較例8	1.07
向上9	1.09
向上10	1.12

第4表から明らかに如く、本発明品の毛成長促進効果は著しいことが判明した。

特許出願人 遠藤株式会社